

(19) 日本国特許庁 (J P)

## (12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開平9-176100

(43) 公開日 平成9年(1997)7月8日

(51) Int.Cl. <sup>8</sup>	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
C 0 7 C 233/69		9547-4H	C 0 7 C 233/69	
A 0 1 N 37/38			A 0 1 N 37/38	
37/40			37/40	
37/48			37/48	
C 0 7 C 213/02		7457-4H	C 0 7 C 213/02	
審査請求 未請求 請求項の数 5 O L (全 19 頁) 最終頁に続く				

(21) 出願番号	特願平8-279180	(71) 出願人	000000206 宇部興産株式会社
(22) 出願日	平成8年(1996)10月22日		山口県宇部市西本町1丁目12番32号
(31) 優先権主張番号	特願平7-275630	(72) 発明者	藤井 勝利
(32) 優先日	平7(1995)10月24日		山口県宇部市大字小串1978番地の5 宇部 興産株式会社宇部研究所内
(33) 優先権主張国	日本 (J P)	(72) 発明者	秦野 耕司
			山口県宇部市大字小串1978番地の5 宇部 興産株式会社宇部研究所内
		(72) 発明者	敷田 庄司
			山口県宇部市大字小串1978番地の5 宇部 興産株式会社宇部研究所内
		最終頁に続く	

(54) 【発明の名称】 N-〔(フルオロアルコキシ) フェノキシアルキル〕ベンズアミド化合物、中間体、それらの製法及び農園芸用の有害生物防除剤

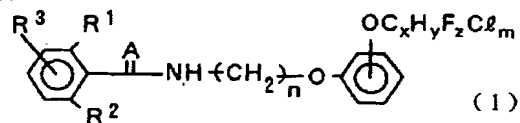
(57) 【要約】

【課題】 殺線虫、殺ダニ、殺菌剤として有用なN-〔(フルオロアルコキシ) フェノキシアルキル〕ベンズアミド誘導体の提供。

【解決手段】 本発明のN-〔(フルオロアルコキシ) フェノキシアルキル〕ベンズアミド化合物は、次式

(1) :

【化30】



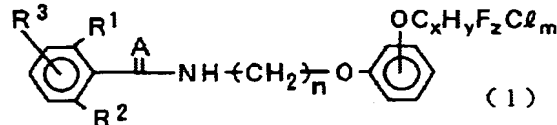
(式中、 $R^1$  及び  $R^3$  は、同一又は相異なってもよい水素原子、ハロゲン原子、C1~4アルキル基、C1~4アルコキシ基、C1~4ハロアルキル基、C1~4ハロアルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、水酸基を表し； $R^2$  は、水素原子、ハロゲン原子、C1~4アルキル基、C1~4アルコキシ基を表し；Aは酸素原子、硫黄原子を表し；xは1~4、yは0~6、zは2~9、mは0

~2の整数を表す。ただし、 $2x+1=y+z+m$ である。)で示される。

## 【特許請求の範囲】

【請求項 1】 次式 (1) :

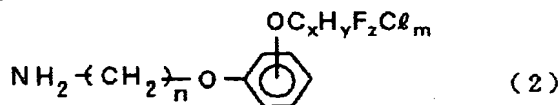
【化 1】



で示される N-〔(フルオロアルコキシ) フェノキシアルキル〕ベンズアミド化合物。なお、式中の R<sup>1</sup> ~ R<sup>3</sup>, A, n, x, y, z 及び m は、次の通りである。R<sup>1</sup> は、水素原子、ハロゲン原子、炭素原子数 1~4 のアルキル基、炭素原子数 1~4 のアルコキシ基、炭素原子数 1~4 のハロアルキル基、炭素原子数 1~4 のハロアルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、又は水酸基を表す。R<sup>2</sup> は、水素原子、ハロゲン原子、炭素原子数 1~4 のアルキル基、又は炭素原子数 1~4 のアルコキシ基を表す。R<sup>3</sup> は、水素原子、ハロゲン原子、炭素原子数 1~4 のアルキル基、炭素原子数 1~4 のアルコキシ基、炭素原子数 1~4 のハロアルキル基、炭素原子数 1~4 のハロアルコキシ基、シアノ基、又はニトロ基を表す。A は、酸素原子、又は硫黄原子を表す。n は、1~6 の整数を表す。x は、1~4 の整数を表す。y は、0~6 の整数を表す。z は、2~9 の整数を表す。m は、0~2 の整数を表す。ただし、2x+1=y+z+m である。

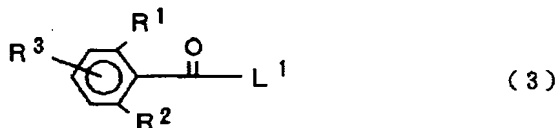
【請求項 2】 次式 (2) :

【化 2】



(式中、n, x, y, z 及び m は、請求項 1 の記載と同義である。) で示される (フルオロアルコキシ) フェノキシアルキルアミン化合物と次式 (3) :

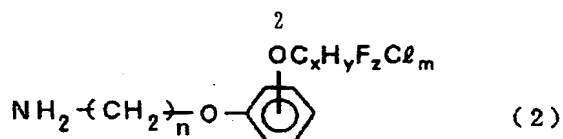
【化 3】



(式中、R<sup>1</sup> ~ R<sup>3</sup> 及び A は、請求項 1 の記載と同義である。L<sup>1</sup> は、ハロゲン原子、又は水酸基を表す。) で示されるカルボン酸化合物とを反応させることを特徴とする請求項 1 記載の式 (1) において A が酸素原子で示される N-〔(フルオロアルコキシ) フェノキシアルキル〕ベンズアミド化合物の製法。

【請求項 3】 次式 (2) :

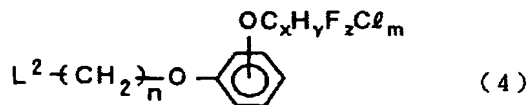
【化 4】



\* (式中、n, x, y, z 及び m は、請求項 1 の記載と同義である。) で示される (フルオロアルコキシ) フェノキシアルキルアミン化合物。

【請求項 4】 次式 (4) :

【化 5】



(式中、L<sup>1</sup> は、ハロゲン原子、メタンスルホニルオキシ基、又はトルエンスルホニルオキシ基を表す。n, x, y, z 及び m は、請求項 1 の記載と同義である。) で示される (フルオロアルコキシ) フェノキシアルキル化合物をアミノ化することを特徴とする請求項 3 記載の式 (2) で示される (フルオロアルコキシ) フェノキシアルキルアミン化合物の製法。

【請求項 5】 請求項 1 記載の式 (1) で示される N-〔(フルオロアルコキシ) フェノキシアルキル〕ベンズアミド化合物を有効成分とする農園芸用の有害生物防除剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、殺線虫剤、殺ダニ剤、殺菌剤などとして有用な農園芸用の有害生物防除剤である新規な N-〔(フルオロアルコキシ) フェノキシアルキル〕ベンズアミド化合物に関するものである。

【0002】

【従来の技術】本発明の目的化合物に近似するベンズアミド化合物としては、次に示す (1), (2) などが知られている。

(1) 特開平 1-105784 号公報には、次式 :

【0003】

【化 6】

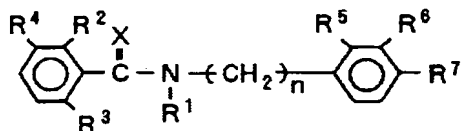


【0004】 (式中、R 及び R<sup>1</sup> は、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、アルキル基、アリル基、シクロアルキル基、アルコキシ基、アリルオキシ基を表し; Z は、炭素原子数 2~4 のアルキレンを表す。なお、この式で定義した R, R<sup>1</sup> 及び Z は、この式だけに限定する。) で示される化合物が、写真材料として有効であることが記載されている。

\* (2) 特開平 1-151546 号公報には、次式 :

【0005】

【化7】



【0006】(式中、XはO、S又はNOHであり、R<sup>1</sup>はH又はCH<sub>3</sub>であり、nは1、2又は3であり、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は以下のパラグラフ：

a) R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>は個別にCl又はBrであり、R<sup>4</sup>はHである：

b) R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は個別にCl又はBrである：

c) R<sup>2</sup>はFであり、R<sup>3</sup>はClであり、R<sup>4</sup>はHである：又は

d) R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>はCH<sub>3</sub>又はC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>であり、R<sup>4</sup>はHであるのいずれかで定義され、

【0007】R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は以下のパラグラフ：

a) R<sup>6</sup>とR<sup>7</sup>の一方はCF<sub>3</sub>であり、R<sup>5</sup>及びR<sup>6</sup>とR<sup>7</sup>の他方はHである：

b) R<sup>5</sup>及びR<sup>6</sup>はHであり、R<sup>7</sup>はF、Cl又はBrである：

c) R<sup>5</sup>及びR<sup>7</sup>は個別にF、Cl又はBrであり、R<sup>6</sup>はHである：

d) R<sup>5</sup>及びR<sup>6</sup>は個別にF、Cl又はBrであり、R<sup>7</sup>はHである：

e) R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は個別にF、Cl又はBrであり、R<sup>5</sup>はHである：又は

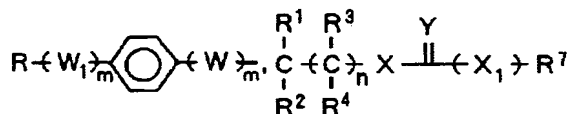
f) R<sup>6</sup>はフェノキシであり、R<sup>5</sup>及びR<sup>7</sup>はHであるのいずれかで定義される。なお、この式で定義したR<sup>1</sup>～R<sup>7</sup>、n及びXは、この式だけに限定する。)で示される化合物が、殺菌剤として有効であることが記載されている。

【0008】本発明の原料化合物に近似する(フルオロアルコキシ)フェノキシアルキルアミン化合物としては、次に示す(3)～(6)などが知られている。

(3) 特開昭61-44846号公報には、次式：

【0009】

【化8】



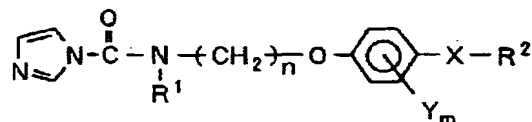
【0010】(式中、m及びm'は、それぞれ独立して0又は1であり；nは、0～3の整数であり；Rは、C1～4アルキル、C2～8アルケニル、C2～8アルキニル、C1～8ハロアルキル、C2～8ハロアルケニル、C2～8ハロアルキニル、C2～10アルコキシアルキル、C2～10アルキルチオアルキル、C3～8シクロアルキル、C3～8ハロシクロアルキル、C4～12シクロアルキルアルキル、ヘテロシクロアルキル又は

ヘテロシクロアルキルアルキルであり；R<sup>1</sup>～R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>はそれぞれ独立して水素又はC1～8アルキルであり；R<sup>7</sup>はC1～8アルキル、C2～8アルケニル、C2～8アルキニル、C1～8ハロアルキル、C2～8ハロアルケニル、C2～8ハロアルキニル、C3～8シクロアルキル、C4～12シクロアルキルアルキル又はフェニルであって非置換のもの、又は環の炭素原子の1、2又は3の位置がC1～8アルキル、C1～8ハロアルキル、C1～8アルコキシ、C1～8ハロアルコキシ、ハロゲン、ニトロ、シアノ及びC1～8アルキルチオから選ばれる基によって置換されるフェニルであり、ただし、X<sup>1</sup>がNR<sup>8</sup>であるときは、R<sup>1</sup>もまた、置換又は非置換のフェニルチオ及びS-C(SH<sub>3</sub>)、-CN基から選ぶことができ；R<sup>8</sup>は、水素原子であり、あるいはR<sup>1</sup>の定義から選ばれ；Wは、酸素、硫黄、NR<sup>8</sup>、CR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>又はカルボニルであり；W'は、酸素、硫黄、NR<sup>8</sup>、CR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>、カルボニル、スルフィニル又はスルホニルであり；X及びYは、それぞれ酸素、硫黄又はNR<sup>8</sup>であり；X<sup>1</sup>は、酸素、硫黄又はNR<sup>8</sup>であり；Zは、C1～8アルキル、C1～8ハロアルキル又はハロゲンである。なお、この式で定義したm、m'、n、R、R<sup>1</sup>～R<sup>7</sup>、W、W'、X、X<sup>1</sup>、Y及びZは、この式だけに限定する。)で示される化合物が、殺虫剤として有効であることが記載されている。

【0011】(4) 特開昭61-68470号公報には、次式：

【0012】

【化9】

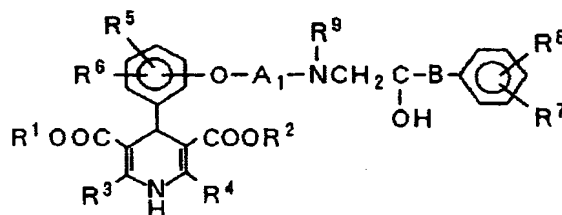


【0013】(式中、R<sup>1</sup>は低級アルキル基、低級アルコキシ-低級アルキル基又は炭素原子数3～8のシクロアルキル基を示し；R<sup>2</sup>はフルオロ置換-低級アルキル基を示し；Xは酸素原子又は硫黄原子を示し；Yはハロゲン原子又は低級アルキル基を示し；mは0、1又は2を示し；nは2～6の整数を示す。なお、この式で定義したR<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、X、Y、m及びnは、この式だけに限定する。)で示される化合物が、殺菌剤として有効であることが記載されている。

(5) 特開昭62-149659号公報には、次式：

【0014】

【化10】

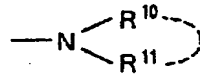


5

【0015】〔式中、 $R^1$  及び  $R^2$  は、同一又は異なる低級アルキル基を表し； $R^3$  及び  $R^4$  は、同一又は異なる低級アルキル基を表し； $R^5$  及び  $R^6$  は、同一又は異なって、水素原子、ニトロ基、シアノ基、ハロゲン低級アルキル基、低級アルケニル基、水酸基、ハロゲン低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、アラルキルオキシ基、アラルケニルオキシ基、カルボキシ基、低級アルコキシカルボニル基、次式：

【0016】

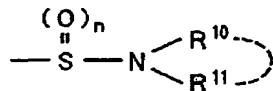
【化11】



【0017】（式中、 $R^{10}$  及び  $R^{11}$  は、同一又は異なり、水素原子又は低級アルキル基を表す。ただし、 $R^{10}$  及び  $R^{11}$  は隣接する窒素原子と一体になってピロリジン環、ピペリジン環、モルホリン環、又は4位の窒素原子が低級アルキル基で置換されてもよいピペラジン環を形成してもよい。）で示される基、次式：

【0018】

【化12】

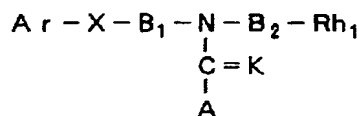


【0019】（式中、 $R^{10}$  及び  $R^{11}$  は、前記と同義である。）で示される基を表し； $R^1$  及び  $R^2$  は、同一又は異なり、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、低級アルカノイルアミノ基、又は隣接するときベンゼン環と一体となったナフチル基を表し； $A_1$  は、アルキレン基、アルケニレン基、又はアルキニレン基を表し； $R^3$  は、水素原子又は低級アルキル基を表し； $B$  は、単結合又は  $\text{CH}_2$ ； $O$  を表し； $n$  は、0、1又は2を表す。ただし、 $R^5$  及び  $R^6$  が、同一又は異なり水素原子もしくはニトロ基であるときは、 $R^3$  が低級アルキル基又は  $A_1$  が分岐状のアルキレン基、アルケニレン基もしくは分岐状のアルキニレン基を表す。なお、この式で定義した  $R^1 \sim R^{11}$ 、 $A_1$ 、 $B$ 、 $m$  及び  $n$  は、この式だけに限定する。）で示される化合物が、カルシウム拮抗作用及び交感神経β受容体遮断作用を有することが記載されている。

(6) 特開平2-142772号公報には、次式：

【0020】

【化13】



【0021】〔式中、 $A_r$  は、非置換又は1個以上のハロゲン、 $C_1 \sim 3$ アルキル、 $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、 $C$

6

2~4アルケニル、 $C_2 \sim 4$ ハロアルケニル、 $C_1 \sim 3$ アルコキシもしくは  $C_1 \sim 4$ ハロアルコキシを置換基として有するフェニル基、非置換又は1個以上のハロゲンもしくは  $C_1 \sim 3$ ハロアルキルを置換基として有するピリジル基を表し； $K$ 、 $X$ 及び $Z$ は、互いに独立して、 $O$ 又は $S$ を表し； $B_1$ 及び $B_2$ は、同一又は異なって、 $C_1 \sim 6$ アルキリデンを表し； $Rh_1$ は、1~9のハロゲン原子を有する  $C_1 \sim 6$ ハロアルキル、1~9のハロゲン原子を有する  $C_1 \sim 6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim 8$ ハロアルコシアルキル、 $C_3 \sim 8$ ハロアルコシアルケニルを表し（ハロゲンは好ましくはフッ素である）； $A$ は、表1に記載した複素環を表す（式中、 $R^1 \sim R^3$ は、同一又は異なってもよく、 $H$ 、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_2 \sim 6$ ハロアルキニルを表し； $G$ は、 $\text{CH}$ 又は $N$ を表す。）。なお、この式で定義した  $A_r$ 、 $K$ 、 $X$ 、 $Z$ 、 $B_1$ 、 $B_2$ 、 $Rh_1$ 、 $A$ 、 $R^1 \sim R^3$  及び  $G$ は、この式だけに限定する。）で示される化合物が殺菌剤として有効であることが記載されている。

20

【0022】

【表1】


30

40

【0023】しかしながら、本発明のようなアミン部位が（フルオロアルコキシ）フェノキシアルキルアミノ基である  $\text{N-}$ 〔（フルオロアルコキシ）フェノキシアルキル〕ベンズアミド化合物及び（フルオロアルコキシ）フェノキシアルキルアミン化合物の開示は認められない。従って、本発明の  $\text{N-}$ 〔（フルオロアルコキシ）フェノキシアルキル〕ベンズアミド化合物及び（フルオロアルコキシ）フェノキシアルキルアミン化合物は新規化合物であり、 $\text{N-}$ 〔（フルオロアルコキシ）フェノキシアルキル〕ベンズアミド化合物が、殺線虫剤、殺ダニ剤、殺菌剤などとして有用な農薬園用の有害生物防除活性を有することについても知られていない。

【0024】

【発明が解決しようとする課題】本発明の目的は、新規な  $\text{N-}$ 〔（フルオロアルコキシ）フェノキシアルキル〕ベンズアミド化合物を有効成分とする殺線虫剤、殺ダニ

50

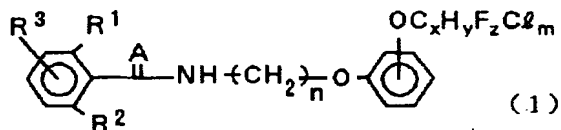
剤、殺菌剤などとして有用な農園芸用の有害生物防除剤を提供することである。

【0025】

【課題を解決するための手段】本発明者らは、前記の課題を解決するために検討した結果、新規なN-〔（フルオロアルコキシ）フェノキシアルキル〕ベンズアミド化合物が殺線虫剤、殺ダニ剤、殺菌剤などとして有用な農園芸用の有害生物防除剤として顕著な防除活性を有することを見出し、本発明を完成するに至った。即ち、本発明は次の通りである。第1の発明は、次式（1）：

【0026】

【化14】

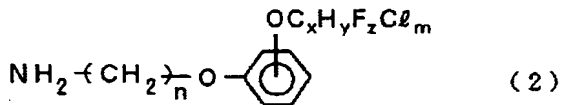


【0027】で示されるN-〔（フルオロアルコキシ）フェノキシアルキル〕ベンズアミド化合物に関するものである。なお、式中のR<sup>1</sup>～R<sup>3</sup>、A、n、x、y、z及びmは、次の通りである。R<sup>1</sup>は、水素原子、ハロゲン原子、炭素原子数1～4のアルキル基、炭素原子数1～4のアルコキシ基、炭素原子数1～4のハロアルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、又は水酸基を表す。R<sup>2</sup>は、水素原子、ハロゲン原子、炭素原子数1～4のアルキル基、又は炭素原子数1～4のアルコキシ基を表す。

【0028】R<sup>1</sup>は、水素原子、ハロゲン原子、炭素原子数1～4のアルキル基、炭素原子数1～4のアルコキシ基、炭素原子数1～4のハロアルコキシ基、炭素原子数1～4のハロアルコキシ基、シアノ基、又はニトロ基を表す。Aは、酸素原子、又は硫黄原子を表す。nは、1～6の整数を表す。xは、1～4の整数を表す。yは、0～6の整数を表す。zは、2～9の整数を表す。mは、0～2の整数を表す。ただし、2x+1=y+z+mである。第2の発明は、次式（2）：

【0029】

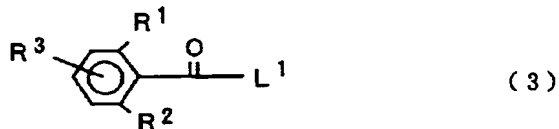
【化15】



【0030】（式中、n、x、y、z及びmは、前記と同義である。）で示される（フルオロアルコキシ）フェノキシアルキルアミン化合物と次式（3）：

【0031】

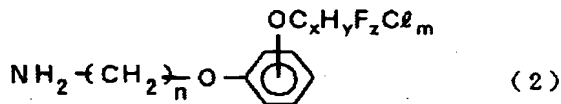
【化16】



\*【0032】（式中、R<sup>1</sup>～R<sup>3</sup>は、前記と同義である。L<sup>1</sup>は、ハロゲン原子、又は水酸基を表す。）で示されるカルボン酸化合物とを反応させることを特徴とする前記の式（1）においてAが酸素原子で示されるN-〔（フルオロアルコキシ）フェノキシアルキル〕ベンズアミド化合物の製法に関するものである。第3の発明は、次式（2）：

【0033】

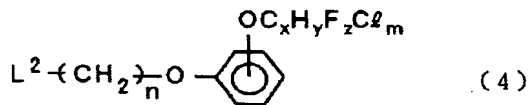
【化17】



【0034】（式中、n、x、y、z及びmは、前記と同義である。）で示される（フルオロアルコキシ）フェノキシアルキルアミン化合物に関するものである。第4の発明は、次式（4）：

【0035】

【化18】



【0036】（式中、L<sup>1</sup>は、ハロゲン原子、メタンスルホニルオキシ基、又はトルエンスルホニルオキシ基を表す。n、x、y、z及びmは、前記と同義である。）で示される（フルオロアルコキシ）フェノキシアルキル化合物をアミノ化することを特徴とする前記の式（2）で示される（フルオロアルコキシ）フェノキシアルキルアミン化合物の製法に関するものである。第5の発明は、前記の式（1）で示されるN-〔（フルオロアルコキシ）フェノキシアルキル〕ベンズアミド化合物を有効成分とする農園芸用の有害生物防除剤に関するものである。

【0037】

【発明の実施の形態】以下、本発明について詳細に説明する。目的化合物である新規なN-〔（フルオロアルコキシ）フェノキシアルキル〕ベンズアミド化合物〔化合物（1）〕並びにその製造原料〔化合物（2）～化合物（5）〕で表したR<sup>1</sup>～R<sup>3</sup>、A、x、y、z、m、n、L<sup>1</sup>、L<sup>2</sup>及び後記式（6）におけるL<sup>1</sup>は、次の通りである。

【0038】 $[R']$   $R'$  としては、水素原子、ハロゲン原子、炭素原子数1~4のアルキル基、炭素原子数1~4のアルコキシ基、炭素原子数1~4のハロアルキル基、炭素原子数1~4のハロアルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、水酸基を挙げることができる。ハロゲン原子としては、塩素原子、ヨウ素原子、臭素原子、フッ素原子などを挙げることができるが；フッ素原子、塩素原子、臭素原子が好ましい。アルキル基としては、直鎖状又は分岐状のものを挙げることができるが；メチル基が好ましい。アルコキシ基としては、直鎖状又は分岐状のものを挙げることができるが；メトキシ基が好ましい。

【0039】ハロアルキル基としては、直鎖状又は分岐状のものを挙げることができ；ハロゲン原子としては塩素原子、ヨウ素原子、臭素原子、フッ素原子を挙げることができるが、好ましくはフッ素原子であり；アルキル部分としては、好ましくはメチルである。そして、ハロアルコキシ基としては、好ましくはCF<sub>3</sub>である。ハロアルコキシ基としては、直鎖状又は分岐状のものを挙げることができ；ハロゲン原子としては塩素原子、ヨウ素原子、臭素原子、フッ素原子を挙げることができるが、好ましくはフッ素原子であり；アルキル部分としては、好ましくはメチルである。そして、ハロアルコキシ基としては、好ましくはCHF<sub>2</sub>、O、CF<sub>3</sub>、Oである。

【0040】 $[R']$   $R'$  としては、水素原子、ハロゲン原子、炭素原子数1~4のアルキル基、炭素原子数1~4のアルコキシ基を挙げることができる。ハロゲン原子としては、塩素原子、ヨウ素原子、臭素原子、フッ素原子を挙げることができるが；フッ素原子が好ましい。アルキル基としては、直鎖状又は分岐状のものを挙げることができるが；メチル基が好ましい。アルコキシ基としては、直鎖状又は分岐状のものを挙げることができるが；メトキシ基が好ましい。

【0041】 $[R']$   $R'$  としては、水素原子、ハロゲン原子、炭素原子数1~4のアルキル基、炭素原子数1~4のアルコキシ基、炭素原子数1~4のハロアルキル基、炭素原子数1~4のハロアルコキシ基、シアノ基、ニトロ基を挙げることができる。ハロゲン原子としては、塩素原子、ヨウ素原子、臭素原子、フッ素原子を挙げることができる。アルキル基としては、直鎖状又は分岐状のものを挙げることができる。アルコキシ基としては、直鎖状又は分岐状のものを挙げることができる。

【0042】ハロアルキル基としては、直鎖状又は分岐状のものを挙げることができ；ハロゲン原子としては塩素原子、ヨウ素原子、臭素原子、フッ素原子を挙げることができるが、好ましくはフッ素原子であり；アルキル部分としては、好ましくはメチルである。そして、ハロアルコキシ基としては、好ましくはCF<sub>3</sub>である。ハロアルコキシ基としては、直鎖状又は分岐状のものを挙げることができ；ハロゲン原子としては塩素原子、ヨウ素原子、臭素原子、フッ素原子を挙げることができるが、好

ましくはフッ素原子であり；アルキル部分としては、好ましくはメチルである。そして、ハロアルコキシ基としては、好ましくはCF<sub>3</sub>、Oである。 $R'$  の置換位置は特に限定されないが；好ましくは4位である。

【0043】 $[OC, H, F, Cl]$   $x$  は、1~4、好ましくは1~3の整数である。 $y$  は、0~6、好ましくは0~4の整数である。 $z$  は、2~9、好ましくは2~6の整数である。 $m$  は、0~2の整数である。ただし、 $2x+1=y+z+m$  である。OC, H, F, Cl の置換位置は、特に限定されないが；好ましくは、3位、4位である。

【A】Aとしては、酸素原子、硫黄原子などを挙げることができる。

【n】 $n$  は、1~6、好ましくは2~5の整数、さらに好ましくは2又は3である。

【0044】 $[L' \sim L']$   $L'$  としては、ハロゲン原子、水酸基を挙げることができ；ハロゲン原子としては、好ましくは塩素原子、臭素原子である。 $L'$  及び $L'$  としては、ハロゲン原子、メタンスルホニルオキシ基、トルエンスルホニルオキシ基を挙げることができ；ハロゲン原子としては、好ましくは塩素原子、臭素原子である。化合物(1)としては、前記の各種の置換基を組み合わせたものを挙げることができるが、薬効の面から好ましいものは、次の通りである。

【0045】(a)  $R' \sim R'$  が水素原子であり、OC, H, F, Cl が3-OC, F, 又は4-OC, F, であり、Aが酸素原子であり、 $n$  が2である化合物(1)。

(1)。

(b)  $R'$  がハロゲン原子であり、 $R'$  及び $R'$  が水素原子であり、OC, H, F, Cl が3-OC, F, 又は4-OC, F, であり、Aが酸素原子であり、 $n$  が2である化合物(1)。

(c)  $R'$  及び $R'$  が水素原子であり、 $R'$  がハロゲン原子であり、OC, H, F, Cl が3-OC, F, 又は4-OC, F, であり、Aが酸素原子であり、 $n$  が2である化合物(1)。

(d)  $R'$  及び $R'$  がハロゲン原子であり、 $R'$  が水素原子であり、OC, H, F, Cl が3-OC, F, 又は4-OC, F, であり、Aが酸素原子であり、 $n$  が2である化合物(1)。

【0046】(e)  $R'$  及び $R'$  がハロゲン原子であり、 $R'$  が水素原子であり、OC, H, F, Cl が3-OC, F, 又は4-OC, F, であり、Aが酸素原子であり、 $n$  が2である化合物(1)。

(f)  $R' \sim R'$  がハロゲン原子であり、OC, H, F, Cl が3-OC, F, 又は4-OC, F, であり、Aが酸素原子であり、 $n$  が2である化合物(1)。

(g)  $R'$  が炭素原子数1~4のアルキル基であり、 $R'$  及び $R'$  が水素原子であり、OC, H, F, Cl が3-OC, F, 又は4-OC, F, であり、Aが酸素原子

であり、nが2である化合物(1)。

(h) R<sup>1</sup> が炭素原子数1~4のアルコキシ基であり、R<sup>2</sup> 及びR<sup>3</sup> が水素原子であり、OC、H、F、Cl、が3-OC、F、又は4-OC、F、であり、Aが酸素原子であり、nが2である化合物(1)。

【0047】(i) R<sup>1</sup> が炭素原子数1~4のハロアルキル基であり、R<sup>2</sup> 及びR<sup>3</sup> が水素原子であり、OC、H、F、Cl、が3-OC、F、又は4-OC、F、であり、Aが酸素原子であり、nが2である化合物(1)。

(j) R<sup>1</sup> 及びR<sup>2</sup> がハロゲン原子であり、R<sup>3</sup> が水素原子であり、OC、H、F、Cl、が4-OC、H、F、であり、Aが酸素原子であり、nが2である化合物(1)。

(k) R<sup>1</sup> 及びR<sup>2</sup> がハロゲン原子であり、R<sup>3</sup> が水素原子であり、OC、H、F、Cl、が4-OC、H、F、Cl、であり、Aが酸素原子であり、nが2である化合物(1)。

(l) R<sup>1</sup> 及びR<sup>2</sup> がハロゲン原子であり、R<sup>3</sup> が水素原子であり、OC、H、F、Cl、が3-OC、F、又は4-OC、F、であり、Aが硫黄原子であり、nが2である化合物(1)。

【0048】(m) R<sup>1</sup> が炭素原子数1~4のハロアルコキシ基であり、R<sup>2</sup> 及びR<sup>3</sup> が水素原子であり、OC、H、F、Cl、が3-OC、F、又は4-OC、F、であり、Aが酸素原子であり、nが2である化合物(1)。

(n) R<sup>1</sup> がニトロ基であり、R<sup>2</sup> 及びR<sup>3</sup> が水素原子であり、OC、H、F、Cl、が3-OC、F、又は4-OC、F、であり、Aが酸素原子であり、nが2である化合物(1)。

(o) R<sup>1</sup> 及びR<sup>2</sup> が炭素原子数1~4のアルキル基であり、R<sup>3</sup> が水素原子であり、OC、H、F、Cl、が3-OC、F、又は4-OC、F、であり、Aが酸素原子であり、nが2である化合物(1)。

(p) R<sup>1</sup> 及びR<sup>2</sup> が炭素原子数1~4のアルコキシ基であり、R<sup>3</sup> が水素原子であり、OC、H、F、Cl、が3-OC、F、又は4-OC、F、であり、Aが酸素原子であり、nが2である化合物(1)。

(q) R<sup>1</sup> が水酸基であり、R<sup>2</sup> 及びR<sup>3</sup> が水素原子であり、OC、H、F、Cl、が3-OC、F、又は4-OC、F、であり、Aが酸素原子であり、nが2である化合物(1)。

【0049】(r) R<sup>1</sup> が水酸基であり、R<sup>2</sup> が水素原子であり、R<sup>3</sup> がハロゲン原子であり、OC、H、F、Cl、が3-OC、F、又は4-OC、F、であり、Aが酸素原子であり、nが2である化合物(1)。

(s) R<sup>1</sup> 及びR<sup>2</sup> がハロゲン原子であり、R<sup>3</sup> が水素原子であり、OC、H、F、Cl、が3-OC、H、F、Cl、又は4-OC、F、であり、Aが酸素原子であり、nが3である化合物(1)。

これらの(a)~(s)で示した化合物(1)としては、前記のR<sup>1</sup>~R<sup>3</sup>、A、x、y、z、m、及びnの説明箇所示した好ましいもの、さらに好ましいものを例示することができる。これらの具体的な化合物(1)としては、後述の表3~6中に記載した化合物{(1-1)~(1-4)、(1-8)、(1-10)、(1-13)~(1-17)、(1-19)、(1-30)、(1-35)、(1-38)、(1-40)、(1-43)、(1-46)、(1-52)、(1-53)、(1-55)、(1-56)}などを挙げる事ができる。

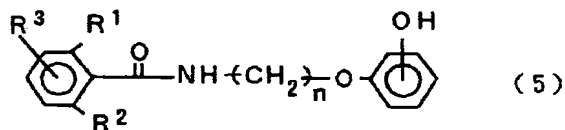
【0050】前記の式(1)で示されるN-〔(フルオロアルコキシ)フェノキシアルキル〕ベンズアミド化合物を製造する好ましい態様としては、第2の発明として記載した合成法1の他に、次の2種の製法(合成法2及び3)を挙げる事ができる。

(合成法2)

次式(5)：

【0051】

【化19】



【0052】(式中、R<sup>1</sup>~R<sup>3</sup>及びnは、前記と同義である。)で示されるベンズアミド化合物と次式

(6)：

【0053】

【化20】



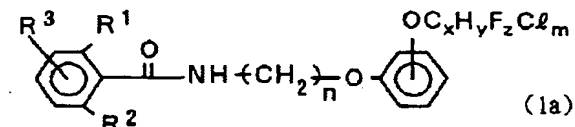
【0054】(式中、L<sup>3</sup>は、ハロゲン原子、メタンスルホニルオキシ基及びトルエンスルホニルオキシ基を表す。x、y及びzは、前記と同義である。)で示されるフルオロアルキル化合物とを、塩基の存在下で反応させることを特徴とする前記の式(1)で示されるN-〔(フルオロアルコキシ)フェノキシアルキル〕ベンズアミド化合物の製法。

(合成法3)

次式(1a)：

【0055】

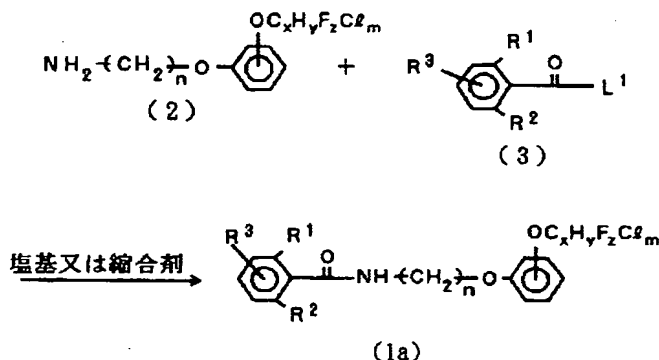
【化21】



【0056】(式中、R<sup>1</sup>~R<sup>3</sup>、x、y、z、m及びnは、前記と同義である。)で示される化合物(1a)を、硫化剤の存在下で反応させることを特徴とする前記の式(1)においてAが硫黄原子で示されるN-〔(フルオロアルコキシ)フェノキシアルキル〕ベンズアミド

化合物〔化合物(1b)と称する。〕の製法。前記の本発明の化合物(1)の合成法1~3を、さらに詳細に述べる。

〔合成法1〕合成法1は、次に示すように、化合物(2)と化合物(3)とを、溶媒中又は無溶媒で、塩基\*



【0058】(式中、 $\text{R}^1 \sim \text{R}^3$ 、 $x$ 、 $y$ 、 $z$ 、 $m$ 、 $n$ 及び $\text{L}'$ は、前記と同義である。)

(1)  $\text{L}'$ がハロゲン原子の場合

前記の製法は、化合物(2)と化合物(3)とを、溶媒中又は無溶媒で、塩基の存在下で反応させることによって行うことができる。溶媒の種類としては、本反応に直接関与しないものであれば特に限定されず、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン、メチルナフタリン、石油エーテル、リグロイン、ヘキサン、クロルベンゼン、ジクロルベンゼン、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロルエタン、トリクロルエチレン、シクロヘキサンのような塩素化された又はされていない芳香族、脂肪族、脂環式の炭化水素類；ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンなどのようなエーテル類；アセトン、メチルエチルケトンなどのようなケトン類；アセトニトリル、プロピオニトリルなどのようなニトリル類；トリエチルアミン、ピリジン、 $N$ 、 $N$ -ジメチルアニリンなどのような有機塩基； $N$ 、 $N$ -ジメチルホルムアミド、 $N$ 、 $N$ -ジメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシド、ジメチルイミダゾリノンなどの極性溶媒；水；前記溶媒の混合物などを挙げることができる。これらの溶媒の内でも、好ましいものは炭化水素類及びエーテル類である。

【0059】溶媒の使用量は、化合物(2)が5~80重量%になるようにして使用することができるが；10~70重量%が好ましい。原料のモル比は任意に設定できるが、通常、化合物(2)1モルに対して化合物

(3)は0.5~2モルの割合である。塩基の種類としては、特に限定されず、例えば、トリエチルアミン、ピリジン、 $N$ 、 $N$ -ジメチルアニリン、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン(DBU)などの有機塩基；水素化ナトリウム、ナトリウムアミド、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウムなどの無機塩基を挙げ※50

\*又は縮合剤の存在下で反応させて化合物(1a)〔化合物(1)におけるAが酸素原子で示される化合物〕を得る方法である。

【0057】

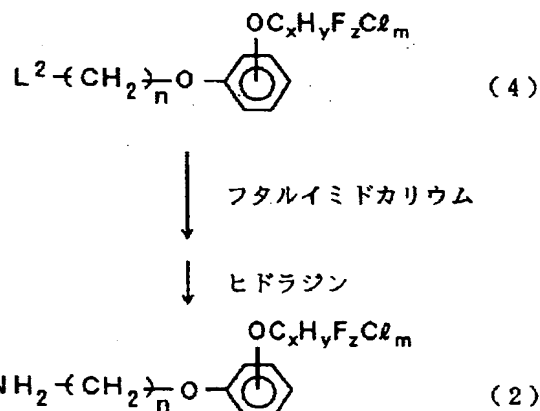
【化22】

※ることができる。

【0060】塩基の使用量は、化合物(2)に対して1~10倍モルであるが；1~5倍モルが好ましい。反応温度は、特に限定されないが、氷冷温度から使用する溶媒の沸点以下の温度範囲内であり；好ましくは0~30℃である。反応時間は、前記の濃度、温度によって変化するが；通常0.1~2時間である。原料化合物(2)は、次に示すように、化合物(4)とフタルイミドカリウムとを溶媒中で反応させ(第1工程)、次いでヒドラジンを反応させること(第2工程)によって得ることができる。

【0061】

【化23】



【0062】(式中、 $\text{L}^1$ 、 $n$ 、 $x$ 、 $y$ 、 $z$ 及び $m$ は、前記と同義である。)

・第1工程

第1工程で使用する溶媒の種類としては、本反応に直接関与しないものであれば特に限定されず、例えば、前記(1)に記載した炭化水素類、エーテル類、ケトン類、ニトリル類、極性溶媒、前記溶媒の混合物などを挙げることができる。フタルイミドカリウムの使用量は、化合物(4)に対して1~10倍モルであるが；好ましくは1



15

～5倍モルである。反応温度は、特に限定されないが、氷冷温度から使用する溶媒の沸点以下の温度範囲内であり；好ましくは40～120℃である。反応時間は、前記の濃度、温度によって変化するが；通常0.5～10時間である。

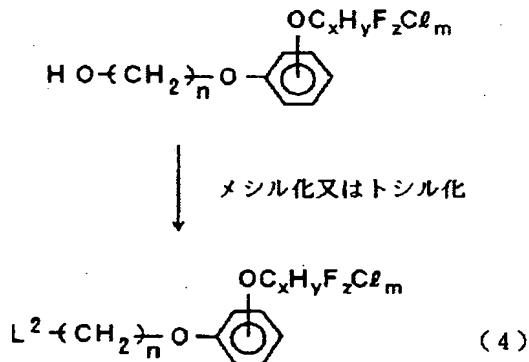
#### 【0063】・第2工程

ヒドラジンとの反応は、前記の第1工程で得られたフルイミド化合物を、単離して又は単離せずにそのまま行うことができる。第2工程で使用する溶媒の種類としては、本反応に直接関与しないものであれば特に限定されず、例えば、前記(1)に記載した炭化水素類、エーテル類、極性溶媒、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールなどのアルコール類、水、前記溶媒の混合物などを挙げることができる。ヒドラジンの使用量は、化合物(4)に対して1～10倍モルであるが；好ましくは1～5倍モルである。反応温度は、特に限定されないが、氷冷温度から使用する溶媒の沸点以下の温度範囲内であり；好ましくは40～120℃である。反応時間は、前記の濃度、温度によって変化するが；通常0.5～10時間である。

【0064】以上のようにして製造された化合物(2)は、反応終了後、抽出、濃縮、濾過などの通常の後処理を行い、必要に応じて再結晶、各種クロマトグラフィーなどの公知の手段で適宜精製することができる。化合物(4)は、次に示すように行うことによって得ることができる。

【0065】

【化24】



【0066】(式中、n, x, y, z, m及びL<sup>1</sup>は、前記と同義である。)

また、化合物(4)は、次に示すように行うことによって得ることができる。

【0067】

【化25】

16

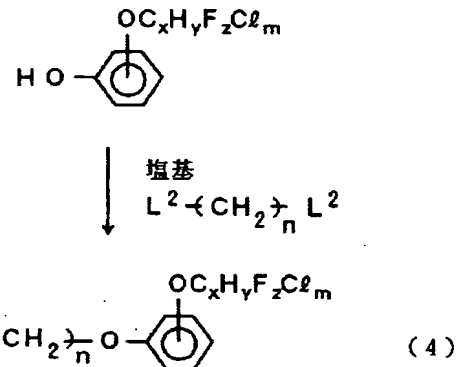
10

20

30

\*

50



\*【0068】(式中、n, x, y, z, m及びL<sup>2</sup>は、前記と同義である。)

化合物(3)は、市販品を使用することができる。

(2) L<sup>1</sup>が水酸基の場合

前記の製法は、化合物(2)と化合物(3)とを、溶媒中又は無溶媒で、縮合剤の存在下で反応させることによって行うことができる。溶媒の種類としては、本反応に直接関与しないものであれば特に限定されず、例えば、前記の(1)に記載したのと同じ炭化水素類、エーテル類、ケトン類、ニトリル類、極性溶媒、それらの混合物を使用することができる。溶媒の使用量は、化合物(2)が5～80重量%になるようにして使用することができるが；10～70重量%が好ましい。

【0069】原料のモル比は任意に設定できるが、通常、化合物(2)1モルに対して化合物(3)は0.5～2モルの割合である。脱水縮合剤の種類は特に限定されず、例えば、ジシクロヘキシルカルボジイミド(DCC)、ジエチルアゾカルボキシレート、ジイソプロピルアゾカルボキシレート、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩(WSC)、1,1'-カルボニルジイミダゾール、硫酸、5塩化リンなどを挙げることができる。脱水縮合剤の使用量は、化合物(2)に対して1～10倍モルであるが；好ましくは1～5倍モルである。反応温度は、特に限定されないが、氷冷温度から使用する溶媒の沸点以下の温度範囲内であり；好ましくは0～50℃である。反応時間は、前記の濃度、温度によって変化するが；通常0.5～8時間である。

【0070】以上のようにして製造された化合物(1a)は、反応終了後、抽出、濃縮、濾過などの通常の後処理を行い、必要に応じて再結晶、各種クロマトグラフィーなどの公知の手段で適宜精製することができる。

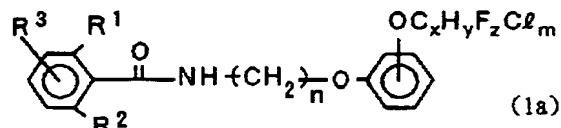
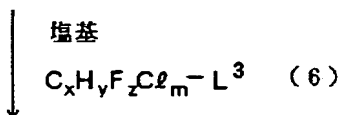
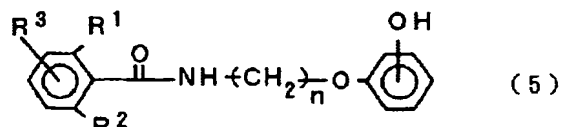
【合成法2】合成法2は、次に示すように、化合物

(5)と化合物(6)とを、溶媒中、塩基存在下で反応させて化合物(1a)〔化合物(1)におけるAが酸素原子で示される化合物〕を得る方法である。

【0071】

【化26】

17



【0072】(式中、 $\text{R}^1 \sim \text{R}^3$ 、 $n$ 、 $x$ 、 $y$ 、 $z$ 、 $m$ 及び $\text{L}^3$ は、前記と同義である。)

溶媒の種類としては、本反応に直接関与しないものであれば特に限定されず、例えば、合成法1に記載の炭化水素類、エーテル類、極性溶媒、水及びこれらの混合物を挙げることができる。

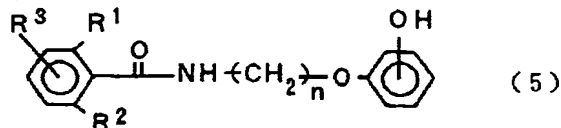
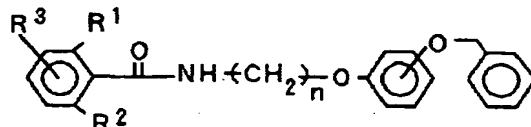
【0073】溶媒の使用量は、化合物(5)が5~80重量%になるようにして使用することができるが、10~70重量%が好ましい。塩基の種類としては、特に限定されず、例えば、前記(1)に記載した有機塩基、無機塩基を挙げることができるが、好ましくは水酸化ナトリウム、水酸化カリウムである。塩基の使用量は、化合物(5)に対して1~10倍モルであるが、2~5倍モルが好ましい。反応温度は、特に限定されないが、氷冷温度から使用する溶媒の沸点以下の温度範囲内であり、好ましくは0~100℃である。反応時間は、前記の濃度、温度によって変化するが、通常0.5~3時間である。

【0074】また、有機溶媒と水との2層系で反応させる場合には、相間移動触媒を用いて反応を促進させることができる。相間移動触媒としては、特に限定されず、例えば、臭化テトラブチルアンモニウム、塩化ベンジルトリエチルアンモニウム、塩化トリカプリルリルメチルアンモニウムなどを挙げることができる。相間移動触媒の使用量は、化合物(5)に対して0.01~5倍モルであるが、好ましくは0.05~0.5倍モルである。以上のようにして製造された化合物(1a)は、反応終了後、抽出、濃縮、濾過などの通常の後処理を行い、必要に応じて再結晶、各種クロマトグラフィーなどの公知の手段で適宜精製することができる。化合物(5)は、次に示すように行うことによって得ることができる。

【0075】

【化27】

18

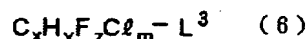


\*【0076】(式中、 $\text{R}^1 \sim \text{R}^3$ 及び $n$ は、前記と同義である。)

化合物(6)は、市販品を使用することができるが、次に示すように行うことによって得ることができる。

【0077】

【化28】



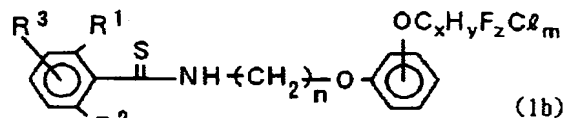
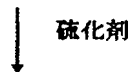
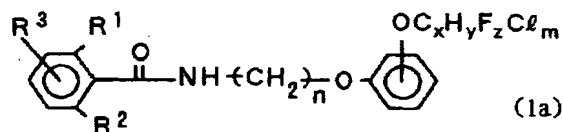
【0078】(式中、 $x$ 、 $y$ 、 $z$ 、 $m$ 及び $\text{L}^3$ は、前記と同義である。)

【合成法3】合成法3は、次に示すように、化合物(1a)を、溶媒中、硫化剤存在下で反応させて化合物(1b)を

【化合物(1)におけるAが硫黄原子で示される化合物】を得る方法である。

【0079】

【化29】



【0080】(式中、 $\text{R}^1 \sim \text{R}^3$ 、 $n$ 、 $x$ 、 $y$ 、 $z$ 及び $m$ は、前記と同義である。)

溶媒の種類としては、本反応に直接関与しないものであれば特に限定されず、例えば、合成法1に記載の炭化水素類、エーテル類及びこれらの混合物を挙げることができる。溶媒の使用量は、化合物(1a)が5~80重量%になるようにして使用することができるが、10~70

重量%が好ましい。硫化剤の種類としては、特に限定されず、例えば、五硫化リン、2, 4-ビス(4-メトキシフェニル)-1, 3-ジチア-2, 4-ジホスフェタン-2, 4-ジスルフィド(ローソン試薬)、硫化水素などを挙げることができる。硫化剤の使用量は、化合物(1a)に対して1~10倍モルであるが、好ましくは1~5倍モルである。

【0081】反応温度は、特に限定されないが、氷冷温度から使用する溶媒の沸点以下の温度範囲内であり、好ましくは40~120℃である。反応時間は、前記の濃度、温度によって変化するが、通常0.5~10時間である。以上のようにして製造された化合物(1b)は、反応終了後、抽出、濃縮、濾過などの通常の後処理を行い、必要に応じて再結晶、各種クロマトグラフィーなどの公知の手段で適宜精製することができる。

【0082】本発明の化合物(1)で防除効果が認められる農園芸における有害生物としては、農園芸害虫(例えば、半翅目(ウンカ類、ヨコバイ類、アブラムシ類、コナジラミ類など)、鱗翅目(ヨトウムシ類、コナガ、ハマキムシ類、メイガ類、シンクイムシ類、モンシロチョウなど)、鞘翅目(ゴミムシダマシ類、ゾウムシ類、ハムシ類、コガネムシ類など)、ダニ目(ハダニ科のミカンハダニ、ナミハダニなど、フシダニ科のミカンサビダニなど)、衛生害虫(例えば、ハエ、カ、ゴキブリなど)、貯穀害虫(コクヌストモドキ類、マメゾウムシ類など)、線虫(ネコブセンチュウ、シストセンチュウ、ネグサレセンチュウ、シンガレセンチュウ、マツノザイセンチュウなど)、ネダニなどを挙げることができる。また、農園芸病原菌(例えば、コムギ赤さび病、大麦うどんこ病、キュウリべと病、イネいもち病、トマト疫病など)を挙げることができる。

【0083】本発明の農園芸用の有害生物防除剤は、特に、殺線虫・殺ダニ・殺菌効果が顕著であり、化合物(1)の1種以上を有効成分として含有するものである。化合物(1)は、単独で使用することもできるが、通常は常法によって、担体、界面活性剤、分散剤、補助剤などを配合(例えば、粉剤、乳剤、微粒剤、粒剤、水和剤、油性の懸濁液、エアゾールなどの組成物として調製する)して使用することが好ましい。

【0084】担体としては、例えば、タルク、ベントナイト、クレー、カオリン、ケイソウ土、ホワイトカーボン、パーミキュライト、消石灰、ケイ砂、硫酸、尿素などの固体担体；炭化水素(ケロシン、鉱油など)、芳香族炭化水素(ベンゼン、トルエン、キシレンなど)、塩素化炭化水素(クロロホルム、四塩化炭素など)、エーテル類(ジオキサン、テトラヒドロフランなど)、ケトン類(アセトン、シクロヘキサノン、イソホロンなど)、エステル類(酢酸エチル、エチレングリコールアセテート、マレイン酸ジブチルなど)、アルコール類(メタノール、n-ヘキサノール、エチレングリコール

など)、極性溶媒(ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドなど)、水などの液体担体；空気、窒素、炭酸ガス、フロンなどの気体担体(この場合には、混合噴射することができる)などを挙げることができる。

【0085】本剤の動植物への付着、吸収の向上、薬剤の分散、乳化、展着などの性能を向上させるために使用できる界面活性剤や分散剤としては、例えば、アルコール硫酸エステル類、アルキルスルホン酸塩、リグニルスルホン酸塩、ポリオキシエチレングリコールエーテルなどを挙げることができる。そして、その製剤の性状を改善するためには、例えば、カルボキシメチルセルロース、ポリエチレングリコール、アラビアゴムなどを補助剤として用いることができる。

【0086】本剤の製造では、前記の担体、界面活性剤、分散剤及び補助剤をそれぞれの目的に応じて、各々単独で又は適当に組み合わせて使用することができる。本発明の化合物(1)を製剤化した場合の有効成分濃度は、乳剤では通常1~50重量%、粉剤では通常0.3~25重量%、水和剤では通常1~90重量%、粒剤では通常0.5~5重量%、油剤では通常0.5~5重量%、エアゾールでは通常0.1~5重量%である。これらの製剤を適当な濃度に希釈して、それぞれの目的に応じて、植物茎葉、土壌、水田の水面に散布するか、又は直接施用することによって各種の用途に供することができる。

#### 【0087】

【実施例】以下、本発明を実施例によって具体的に説明する。なお、これらの実施例は、本発明の範囲を限定するものではない。

#### 実施例1〔化合物(2)の合成〕

(1) 2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)エチルアミン〔化合物(2-2)〕の合成

メタンスルホン酸2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)エチルエステル(3.00g)をN,N-ジメチルホルムアミド(20ml)に溶解し、フタルイミドカリウム(2.04g)を加え、100℃で3時間攪拌した。反応終了後、水(100ml)を加えて攪拌し、生じた沈殿を濾過によって取り出した。得られた沈殿物をエタノール(30ml)に加えて加熱溶解した後、抱水ヒドラジン(0.55g)を加えて3時間加熱還流した。反応終了後、減圧下にエタノールを留去し、続いて5N水酸化ナトリウム水溶液(50ml)を加えて沈殿を溶解し、酢酸エチルで目的化合物を抽出した。次いで、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥して減圧下に溶媒を留去し、シリカゲルクロマト(ワコーゲルC-200、酢酸エチル溶出に続けて、エタノールで溶出)で精製することによって、淡黄色油状物である目的化合物を1.54g得た。

【0088】<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>, δppm)

2.18~2.47(2H, br)、3.11(2H,

21

t, J=5.1 Hz)、3.91~4.09 (2H, m)、6.88~7.25 (4H, m)

【0089】(2) 2-[4-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)フェノキシ]エチルアミン〔化合物(2-3)〕の合成

2-[4-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)フェノキシ]エチルブロミド(4.50g)をN,N-ジメチルホルムアミド(30ml)に溶解し、フタルイミドカリウム(3.05g)を加え、100℃で3時間攪拌した。反応終了後、水(120ml)を加えて攪拌し、生じた沈殿を濾過によって取り出した。得られた沈殿物をエタノール(50ml)に加えて加熱溶解した後、抱水ヒドラジン(0.55g)を加えて3時間加熱還流した。反応終了後、5N塩酸(50ml)を加えて攪拌し、熱時濾過した。得られた濾液をトルエンで洗浄し、続いて水層を5N水酸化ナトリウム水溶液で塩基性とし、酢酸エチルで目的化合物を抽出した。次いで、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下に溶媒を留去することによって、淡黄色油状物である目的化合物を2.57g得た。

【0090】<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>, δ ppm)

1.39~1.54(2H, br)、2.95~3.13(2H, m)、3.87~4.37(4H, m)、6.74~6.97(4H, m)

【0091】(3) 2-[4-(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ)フェノキシ]エチルアミン〔化合物(2-5)〕の合成

メタンスルホン酸2-[4-(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ)フェノキシ]エチルエステル(1.61g)をN,N-ジメチルホルムアミド(10ml)に溶解し、フタルイミドカリウム(1.02g)を加え、100℃で3時間攪拌した。反応終了後、水(50ml)を加えて析出した結晶を濾集し、粉碎後水洗した。次いで、これをエタノール(20ml)で加熱溶解した後、抱水ヒドラジン(0.28g)を加えて3時間攪拌した。反応終了後、減圧下にエタノールを留去し、次いで5N水酸化ナトリウム(30ml)を加えて析出物を溶解し、酢酸エチルで目的化合物を抽出した。次いで、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下に酢酸エチルを留去した。得られた油状物をシリカゲルクロマト(ワコーゲルC-200、酢酸エチル~エタノール溶出)で精製することによって、淡黄色油状液体である目的化合物を0.89g得た。

【0092】<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>, δ ppm)

1.82~2.19(2H, br)、3.01~3.20(2H, br)、3.98(2H, t)、5.89(1H, m)、6.86~7.18(4H, m)

【0093】(4) 2-[4-(2-クロロ-1, 1, 2-トリフルオロエトキシ)フェノキシ]エチルアミン〔化合物(2-6)〕の合成

22

2-[4-(2-クロロ-1, 1, 2-トリフルオロエトキシ)フェノキシ]エチルブロミド(5.00g)をN,N-ジメチルホルムアミド(30ml)に溶解し、フタルイミドカリウム(3.05g)を加え、100℃で3時間攪拌した。反応終了後、水(120ml)を加えて攪拌し、生じた沈殿を濾過によって取り出した。得られた沈殿物をエタノール(50ml)に加えて加熱溶解した後、抱水ヒドラジン(0.83g)を加えて3時間加熱還流した。反応終了後、5N塩酸(70ml)を加えて攪拌し、熱時濾過した。得られた濾液をトルエンで洗浄し、続いて水層を5N水酸化ナトリウム水溶液で塩基性とし、酢酸エチルで目的化合物を抽出した。次いで、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下に溶媒を留去することによって、淡黄色油状物である目的化合物を2.73g得た。

【0094】<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>, δ ppm)

1.18~1.75(2H, br)、2.95~3.14(2H, m)、3.49(2H, t, J=4.9 Hz)、6.14~6.35(1H, m)、6.74~7.26(4H, m)

【0095】(5) 2-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)エチルアミン〔化合物(2-9)〕の合成

メタンスルホン酸2-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)エチルエステル(3.00g)をN,N-ジメチルホルムアミド(20ml)に溶解し、フタルイミドカリウム(2.04g)を加え、100℃で3時間攪拌した。反応終了後、水(100ml)を加えて攪拌し、生じた沈殿を濾過によって取り出した。得られた沈殿物をエタノール(30ml)に加えて加熱溶解した後、抱水ヒドラジン(0.55g)を加えて3時間加熱還流した。反応終了後、5N塩酸(50ml)を加えて攪拌し、熱時濾過した。得られた濾液をトルエンで洗浄し、続いて水層を5N水酸化ナトリウム水溶液で塩基性とし、酢酸エチルで目的化合物を抽出した。次いで、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下に溶媒を留去することによって、淡黄色油状物である目的化合物を1.76g得た。

【0096】<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>, δ ppm)

1.61~1.92(2H, br)、3.09(2H, t, J=5.1 Hz)、3.99(2H, t, J=5.1 Hz)、6.67~7.35(4H, m)

【0097】(6) 3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)プロピルアミン〔化合物(2-10)〕の合成

メタンスルホン酸3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)プロピルエステル(3.14g)をN,N-ジメチルホルムアミド(20ml)に溶解し、フタルイミドカリウム(2.04g)を加え、100℃で3時間攪拌した。反応終了後、水(100ml)を加えて攪拌し、生じた沈殿を濾過によって取り出した。得られた沈殿物をエタノール(30ml)に加えて加熱溶解した

後、抱水ヒドラジン（0.55g）を加えて2時間加熱還流した。反応終了後、5N塩酸（50ml）を加えて攪拌し、熱時濾過した。得られた濾液をトルエンで洗浄し、続いて水層を5N水酸化ナトリウム水溶液で塩基性とし、酢酸エチルで目的化合物を抽出した。次いで、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下に溶媒を留去することによって、淡黄色油状物である目的化合物を1.68g得た。

【0098】<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ ppm)

1.81~2.06 (2H, m)、2.22~2.51\*10

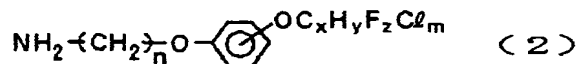
\* (2H, br)、2.93 (2H, t, J=6.6 Hz)、4.04 (2H, t, J=5.9 Hz)、6.77~7.24 (4H, m)

【0099】(7) 表2中のその他の化合物(2)の合成前記(1)~(6)のいずれかの方法に準じて、表2中のその他の化合物(2)を合成した。

以上のようにした合成した化合物及びその物性を表2に示す。

【0100】

【表2】



化合物	OC <sub>x</sub> H <sub>y</sub> F <sub>z</sub> Cl <sub>m</sub>	n	物 性
2-1	4-OCHF <sub>2</sub>	2	
2-2	4-OCF <sub>3</sub>	2	n <sup>20.0</sup> <sub>D</sub> 1.4654
2-3	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	2	n <sup>20.0</sup> <sub>D</sub> 1.4768
2-4	4-OCF <sub>2</sub> CFH <sub>2</sub>	2	
2-5	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	2	n <sup>20.0</sup> <sub>D</sub> 1.4688
2-6	4-OCF <sub>2</sub> CFCℓH	2	n <sup>20.0</sup> <sub>D</sub> 1.4834
2-7	4-OCF <sub>2</sub> CHFCF <sub>3</sub>	2	
2-8	2-OCF <sub>3</sub>	2	
2-9	3-OCF <sub>3</sub>	2	n <sup>20.0</sup> <sub>D</sub> 1.4635
2-10	4-OCF <sub>3</sub>	3	n <sup>20.0</sup> <sub>D</sub> 1.4676
2-11	4-OCF <sub>3</sub>	5	

【0101】実施例2〔化合物(1)の合成〕

実施例1で得た化合物(2)を用いて、目的化合物(1)を合成した。

(1) N-〔2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)エチル〕-2-フルオロベンズアミド〔化合物(1-2)〕の合成

2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)エチルアミン(1.10g)と2-フルオロ安息香酸(0.70g)とのジクロロメタン(20ml)の溶液にWSC〔1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩〕(1.10g)を加え、室温で3時間攪拌した。反応終了後、反応混合物に水(10m

40 1)を加えて抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後に溶媒を減圧下で留去した。得られた残渣をシリカゲルクロマト(ワコーゲルC-200、トルエン：酢酸エチル=9：1溶出)で精製することによって、無色結晶の目的化合物を1.21g得た。

【0102】<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ ppm)

3.87~4.22 (4H, m)、6.85~7.52 (8H, m)、8.06~8.14 (1H, m)

【0103】(2) N-〔2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)エチル〕-2-クロロベンズアミド〔化合物(1-3)〕の合成

2- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) エチルアミン (1.10 g) とトリエチルアミン (0.51 g) とのテトラヒドロフラン (20 ml) の溶液に、2-クロロベンゾイルクロリド (0.88 g) のテトラヒドロフラン (5 ml) の溶液を氷冷攪拌下で滴下し、さらに室温で1時間攪拌した。反応終了後、生じたトリエチルアミン塩酸塩を濾別し、減圧下でその溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルクロマト (ワコーゲルC-200、トルエン：酢酸エチル=9：1溶出) で精製することによって、無色結晶の目的化合物を1.53 g得た。

【0104】<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ ppm)

3.78~4.22 (4H, m)、6.52~6.80 (1H, br)、6.80~7.87 (8H, m)

【0105】(3) N- [2- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) エチル] -2, 6-ジフルオロベンズアミド [化合物(1-10)] の合成

2- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) エチルアミン (1.10 g) とトリエチルアミン (0.51 g) とのテトラヒドロフラン (20 ml) の溶液に、2, 6-ジフルオロベンゾイルクロリド (0.88 g) のテトラヒドロフラン (5 ml) の溶液を氷冷攪拌下で滴下し、さらに室温で1時間攪拌した。反応終了後、生じたトリエチルアミン塩酸塩を濾別し、減圧下でその溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルクロマト (ワコーゲルC-200、トルエン：酢酸エチル=9：1溶出) で精製することによって、無色結晶の目的化合物を1.48 g得た。

【0106】<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ ppm)

3.78~4.22 (4H, m)、6.28~6.53 (1H, br)、6.78~7.47 (7H, m)

【0107】(4) N- [2- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) エチル] -2, 4, 6-トリフルオロベンズアミド [化合物(1-14)] の合成

2- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) エチルアミン (1.10 g) と2, 4, 6-トリフルオロ安息香酸 (0.87 g) とのジクロロメタン (20 ml) の溶液にWSC (1.15 g) を加え、室温で3時間攪拌した。反応終了後、反応混合物に水 (10 ml) を加えて抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後に溶媒を減圧下で留去した。得られた残渣をシリカゲルクロマト (ワコーゲルC-200、トルエン：酢酸エチル=9：1溶出) で精製することによって、無色結晶の目的化合物を1.27 g得た。

【0108】<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ ppm)

3.77~4.23 (4H, m)、6.26~6.48 (1H, br)、6.61~7.26 (6H, m)

【0109】(5) N- [2- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) エチル] -2-メチルベンズアミド [化合物(1-15)] の合成

2- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) エチルアミン (1.10 g) とトリエチルアミン (0.51 g) とのテトラヒドロフラン (20 ml) の溶液に、2-メチルベンゾイルクロリド (0.77 g) のテトラヒドロフラン (5 ml) の溶液を氷冷攪拌下で滴下し、さらに室温で1時間攪拌した。反応終了後、生じたトリエチルアミン塩酸塩を濾別し、減圧下でその溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルクロマト (ワコーゲルC-200、トルエン：酢酸エチル=9：1溶出) で精製することによって、無色結晶の目的化合物を1.31 g得た。

【0110】<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ ppm)

2.44 (3H, s)、3.75~4.20 (4H, m)、6.14~6.32 (1H, br)、6.80~7.41 (8H, m)

【0111】(6) N- [2- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) エチル] -2-トリフルオロメチルベンズアミド [化合物(1-17)] の合成

2- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) エチルアミン (1.10 g) とトリエチルアミン (0.51 g) とのテトラヒドロフラン (20 ml) の溶液に、2-トリフルオロメチルベンゾイルクロリド (1.04 g) のテトラヒドロフラン (5 ml) の溶液を氷冷攪拌下で滴下し、さらに室温で1時間攪拌した。反応終了後、生じたトリエチルアミン塩酸塩を濾別し、減圧下でその溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルクロマト (ワコーゲルC-200、トルエン：酢酸エチル=9：1溶出) で精製することによって、無色結晶の目的化合物を1.67 g得た。

【0112】<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ ppm)

3.79~4.18 (4H, m)、6.15~6.31 (1H, br)、6.80~7.76 (8H, m)

【0113】(7) N- [2- (4-ジフルオロメトキシフェノキシ) エチル] -2, 6-ジフルオロベンズアミド [化合物(1-35)] の合成

N- [2- (4-ヒドロキシフェノキシ) エチル] -2, 6-ジフルオロベンズアミド (1.16 g)、水酸化カリウム (1.10 g) とテトラブチルアンモニウムブロミド (0.10 g) とを、ジクロロメタン (30 ml) と水 (10 ml) との混合溶液に加え、室温攪拌下でクロロジフルオロメタン (3.50 g) をゆっくり吹き込み、さらに室温で1時間攪拌した。反応終了後、反応混合物にジクロロメタンを加えて抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後に溶媒を減圧下で留去した。得られた残渣をシリカゲルクロマト (ワコーゲルC-200、トルエン：酢酸エチル=9：1溶出) で精製することによって、無色結晶の目的化合物を0.87 g得た。

【0114】<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ ppm)

3.78~4.20 (4H, m)、6.42 (1H,

27

t, J=74.2), 6.28~6.51 (1H, br), 6.71~7.44 (7H, m)

【0115】(8) N-[2-[4-(2-クロロ-1, 1, 2-トリフルオロエトキシ)フェノキシ]エチル]-2, 6-ジフルオロベンズアミド【化合物(1-38)】の合成

2-[4-(2-クロロ-1, 1, 2-トリフルオロエトキシ)フェノキシ]エチルアミン(1.08g)とトリエチルアミン(0.40g)とのテトラヒドロフラン(20ml)の溶液に、2, 6-ジフルオロベンゾイルクロリド(0.71g)のテトラヒドロフラン(5ml)の溶液を氷冷攪拌下で滴下し、さらに室温で1時間攪拌した。反応終了後、生じたトリエチルアミン塩酸塩を濾別し、減圧下でその溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルクロマト(ワコーゲルC-200、トルエン：酢酸エチル=9:1溶出)で精製することによって、無色結晶の目的化合物を1.76g得た。

【0116】<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ ppm) 3.77~4.21 (4H, m), 6.14~6.35 (1H, m), 6.53~6.73 (1H, br), 6.73~7.44 (7H, m)

【0117】(9) N-[2-[4-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)フェノキシ]エチル]-2, 6-ジフルオロベンズアミド【化合物(1-40)】の合成

2-[4-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)フェノキシ]エチルアミン(0.94g)とトリエチルアミン(0.40g)とのテトラヒドロフラン(20ml)の溶液に、2, 6-ジフルオロベンゾイルクロリド(0.70g)のテトラヒドロフラン(5ml)の溶液を氷冷攪拌下で滴下し、さらに室温で1時間攪拌した。反応終了後、生じたトリエチルアミン塩酸塩を濾別し、減圧下でその溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルクロマト(ワコーゲルC-200、トルエン：酢酸エチル=9:1溶出)で精製することによって、無色結晶の目的化合物を1.18g得た。

【0118】<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ ppm) 3.80~4.40 (6H, m), 6.28~6.53 (1H, br), 6.72~7.44 (7H, m)

【0119】(10) N-[3-(4-トリフルオロメトキシ

28

\* シフェノキシ)プロピル]-2, 6-ジフルオロベンズアミド【化合物(1-43)】の合成

3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)プロピルアミン(1.18g)とトリエチルアミン(0.50g)とのテトラヒドロフラン(20ml)の溶液に、2, 6-ジフルオロベンゾイルクロリド(0.88g)のテトラヒドロフラン(5ml)の溶液を氷冷攪拌下で滴下し、さらに室温で1時間攪拌した。反応終了後、生じたトリエチルアミン塩酸塩を濾別し、減圧下でその溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルクロマト(ワコーゲルC-200、トルエン：酢酸エチル=9:1溶出)で精製することによって、無色結晶の目的化合物を1.38g得た。

【0120】<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ ppm) 2.03~2.21 (2H, m), 3.57~4.17 (4H, m), 6.19~6.38 (1H, br), 6.74~7.43 (7H, m)

【0121】(11) N-[2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)エチル]-2, 6-ジフルオロベンズチオアミド【化合物(1-46)】の合成

N-[2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)エチル]-2, 6-ジフルオロベンズアミド(1.44g)のトルエン(20ml)の溶液に、ローソン試薬(1.94g)を加え、3時間加熱還流した。反応終了後、減圧下で溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルクロマト(ワコーゲルC-200、トルエン：酢酸エチル=20:1溶出)で精製することによって、淡黄色結晶の目的化合物を1.56g得た。

【0122】<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ ppm) 4.20~4.37 (4H, m), 6.79~7.38 (7H, m), 7.71~7.89 (1H, br)

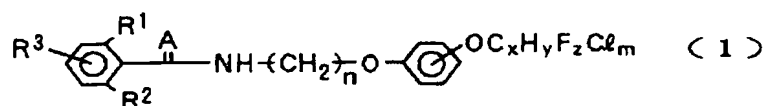
【0123】(12) 表3~6中のその他の化合物(1)の合成

前記(1)~(11)に記載の方法に準じて、表3~6中のその他の化合物(1)を合成した。

以上のようにした合成した化合物及びその物性を表3~6に示す。

【0124】

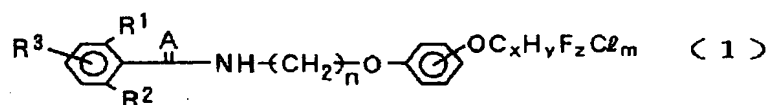
【表3】



化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	OC <sub>x</sub> H <sub>y</sub> F <sub>z</sub> Cl <sub>m</sub>	A	n	物 性
1-1	H	H	H	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	融点 93~95 °C
1-2	F	H	H	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	融点 57~58 °C
1-3	Cl	H	H	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	融点 68~70 °C
1-4	Br	H	H	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	融点 82~84 °C
1-5	H	H	3-F	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	
1-6	H	H	3-Cl	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	
1-7	H	H	4-F	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	
1-8	H	H	4-Cl	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	融点 108~110 °C
1-9	H	H	4-Br	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	
1-10	F	F	H	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	融点 79~81 °C
1-11	F	Cl	H	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	融点 104~105 °C
1-12	Cl	Cl	H	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	融点 133~134 °C
1-13	F	H	4-F	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	融点 66~67 °C
1-14	F	F	4-F	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	融点 113~114 °C
1-15	CH <sub>3</sub>	H	H	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	融点 56~58 °C
1-16	CH <sub>3</sub> O	H	H	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	n <sub>D</sub> <sup>20</sup> 1.5260

[0125]

【表4】

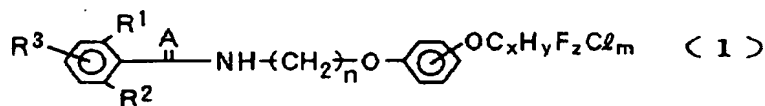


化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	OC <sub>x</sub> H <sub>y</sub> F <sub>z</sub> Cl <sub>m</sub>	A	n	物 性
1-17	CF <sub>3</sub>	H	H	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	融点 72~74 °C
1-18	CHF <sub>2</sub> O	H	H	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	
1-19	CF <sub>3</sub> O	H	H	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	融点 69~70 °C
1-20	CF <sub>3</sub>	H	H	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	融点 108~110 °C
1-21	H	H	3-CH <sub>3</sub>	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	
1-22	H	H	3-CH <sub>3</sub> O	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	
1-23	H	H	3-CF <sub>3</sub>	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	
1-24	H	H	3-CF <sub>3</sub> O	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	
1-25	H	H	4-CH <sub>3</sub>	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	
1-26	H	H	4-CH <sub>3</sub> O	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	
1-27	H	H	4-CF <sub>3</sub>	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	融点 101~104 °C
1-28	H	H	4-CF <sub>3</sub> O	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	融点 74~76 °C
1-29	CN	H	H	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	融点 95~98 °C
1-30	NO <sub>2</sub>	H	H	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	融点 99~100 °C
1-31	H	H	3-CN	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	融点 76~77 °C
1-32	H	H	3-NO <sub>2</sub>	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	

[0126]

【表5】

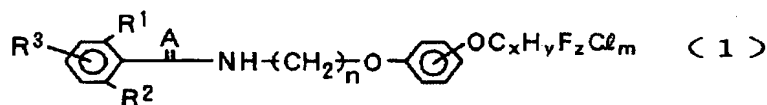




化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	OC <sub>x</sub> H <sub>y</sub> F <sub>z</sub> Cl <sub>m</sub>	A	n	物 性
1-33	H	H	4-CN	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	
1-34	H	H	4-NO <sub>2</sub>	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	融点 123~125℃
1-35	F	F	H	4-OCHF <sub>2</sub>	O	2	融点 86~89℃
1-36	F	F	H	4-OCF <sub>2</sub> CFH <sub>2</sub>	O	2	
1-37	F	F	H	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	O	2	融点 88~100℃
1-38	F	F	H	4-OCF <sub>2</sub> CFCℓH	O	2	融点 82~84℃
1-39	F	F	H	4-OCF <sub>2</sub> CFHCF <sub>3</sub>	O	2	
1-40	F	F	H	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	O	2	融点 122~124℃
1-41	F	F	H	2-OCF <sub>3</sub>	O	2	
1-42	F	F	H	3-OCF <sub>3</sub>	O	2	融点 65~67℃
1-43	F	F	H	4-OCF <sub>3</sub>	O	3	融点 108~109℃
1-44	F	F	H	4-OCF <sub>3</sub>	O	5	
1-45	F	F	H	4-OCHF <sub>2</sub>	S	2	
1-46	F	F	H	4-OCF <sub>3</sub>	S	2	融点 64~65℃
1-47	F	F	H	4-OCF <sub>2</sub> CFH <sub>2</sub>	S	2	
1-48	F	F	H	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	S	2	

【0127】

【表6】



化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	OC <sub>x</sub> H <sub>y</sub> F <sub>z</sub> Cl <sub>m</sub>	A	n	物 性
1-49	F	F	H	4-OCF <sub>2</sub> CFCℓH	S	2	
1-50	F	F	H	4-OCF <sub>2</sub> CFHCF <sub>3</sub>	S	2	
1-51	F	F	H	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	S	2	
1-52	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	融点 122~123℃
1-53	CH <sub>3</sub> O	CH <sub>3</sub> O	H	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	融点 112~113℃
1-54	CH <sub>3</sub>	Cl	H	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	
1-55	OH	H	H	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	融点 103~105℃
1-56	OH	H	4-Cl	4-OCF <sub>3</sub>	O	2	融点 101~102℃

## 【0128】実施例3〔製剤の調製〕

## (1) 粒剤の調製

化合物(1-1)を5重量部、ベントナイト35重量部、タルク57重量部、ネオベレックスパウダー(商品名;花王株式会社製)1重量部及びリグニンスルホン酸ソーダ2重量部を均一に混合し、次いで少量の水を添加して混練した後、造粒、乾燥して粒剤を得た。

## 【0129】(2) 水和剤の調製

化合物(1-1)を10重量部、カオリン70重量部、ホワイトカーボン18重量部、ネオベレックスパウダー(商品名;花王株式会社製)1.5重量部及びデモール(商品名;花王株式会社製)0.5重量部とを均一に混合し、次いで粉碎して水和剤を得た。

## 【0130】(3) 乳剤の調製

化合物(1-1)を20重量部及びキシレン70重量部に、

トキサノン(商品名;三洋化成工業製)10重量部を加えて均一に混合し、溶解して乳剤を得た。

## 【0131】(4) 粉剤の調製

化合物(1-1)を5重量部、タルク50重量部及びカオリン45重量部を均一に混合して粉剤を得た。

## 【0132】実施例4〔効力試験〕

(1) サツマイモネコブセンチュウに対する効力試験  
実施例3に準じて調製した表3~6に示す化合物(1)の各水和剤を水で300ppmに希釈し、そのうち0.1mlを試験管にとり、サツマイモネコブセンチュウ約500頭を含む水溶液0.9mlを加えた(終濃度30ppm)。次に、これらの試験管を25℃の定温室に放置し、2日後に顕微鏡下で観察して殺線虫率を求めた。殺線虫効果の評価は、殺線虫率の範囲によって、A~Dの4段階(A:100%, B:100未満~80%,

C: 80未満～60%, D: 60%未満) で示した。これらの結果を表7に示す。

【0133】

【表7】

表7 サツマイモネコブセンチュウに対する効力試験

化 合 物	効 果
1-2	A
1-3	A
1-10	A
1-14	A
1-15	A
1-16	A
1-17	A
1-30	A
1-35	A
1-37	A
1-38	A
1-40	A
1-43	A
1-46	A

【0134】(2) ナミハダニ卵に対する効力試験

実施例3に準じて調製した表3～6に示す化合物(1)の各水和剤を界面活性剤(0.01%)を含む水で300ppmに希釈し、これらの各薬液中に15頭のナミハダニ雌成虫を24時間寄生産卵させた後に成虫を除去した各インゲン葉片(直径20mm)を10秒間づつ浸漬した。次に、これらの各葉片を入れた試験管を25℃の定温室に放置し、6日後に各葉片における未羽化数を数えて殺卵率を求めた。

【0135】殺卵効果の評価は、殺卵率の範囲によって、A～Dの4段階(A:100%, B:100未満～80%, C:80未満～60%, D:60%未満)で示した。これらの殺卵効果の評価の結果を表8に示す。

【0136】

【表8】

表8 ナミハダニ卵に対する効力試験

化 合 物	効 果
1-2	A
1-4	A
1-13	A
1-19	A
1-30	A
1-35	A
1-46	A

【0137】(3) イネいもち病に対する防除効力試験(予防効果)

直径6cmのプラスチック植木鉢に1鉢あたり10本のイネ(品種;日本晴)を育成し、1.5葉期の幼植物体に、実施例3に準じて調製した表3～6で示した化合物(1)の各水和剤を、界面活性剤(0.05%)を含む水で500ppmに希釈して、1鉢あたり20mlづつ散布した。散布後、2日間ガラス温室で栽培し、次いで、罹病葉から調製したイネいもち病菌の分生孢子懸濁

液を植物葉に均一に噴霧接種した。接種後、5日間28℃湿室内で育成し、葉に現れたイネいもち病病斑の程度を調査した。

【0138】殺菌効果の評価は、無処理区の病斑の程度と比較して、0～5の6段階(0:全体が罹病、1:病斑面積が60%程度、2:病斑面積が40%程度、3:病斑面積が20%程度、4:病斑面積が10%以下、5:病斑無し)で示した。その結果を表9に示す。

【0139】

10 【表9】

表9 イネいもち病に対する効力試験(予防効果)

化 合 物	効 果
1-1	3
1-2	1
1-8	4
1-10	1
1-13	1
1-19	2
1-46	2
1-55	2
1-56	4
無処理区	0

【0140】(4) コムギ赤さび病に対する防除効力試験(予防効果)

直径6cmのプラスチック植木鉢に1鉢あたり10本づつコムギ(品種;コブシコムギ)を育成し、1.5葉期の幼植物体に、実施例3に準じて調製した表3～6で示した化合物(1)の水和剤を、界面活性剤(0.05%)を含む水で500ppmに希釈して、1鉢あたり20mlで散布した。散布後、2日間ガラス温室で栽培し、次いで、コムギ赤さび病菌の孢子懸濁液(3×10<sup>5</sup> 孢子/ml)を植物体に均一に噴霧接種した。接種後、1週間ガラス温室内で育成し、第一葉に現れたコムギ赤さび病病斑の程度を調査した。その結果を、前記の(3)に記載した6段階の評価方法で、表10に示す。

【0141】

【表10】

表10 コムギ赤さび病に対する効力試験(予防効果)

化 合 物	効 果
1-1	4
1-2	3
1-8	3
1-10	1
1-13	1
1-19	2
1-30	3
1-46	1
1-52	2
1-53	4
1-55	3
1-56	2
無処理区	0

【0142】

【発明の効果】本発明の新規なN-〔（フルオロアルコキシ）フェノキシアルキル〕ベンズアミド誘導体は、殺\*

\*線虫、殺ダニ、殺菌などの優れた効果を有するものである。

フロントページの続き

(51) Int. Cl. <sup>4</sup>	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
C 0 7 C 217/20		7457-4H	C 0 7 C 217/20	
231/02			231/02	
235/48		9547-4H	235/48	
235/60		9547-4H	235/60	
253/30		8927-4H	253/30	
255/57		8927-4H	255/57	
327/48		7106-4H	327/48	

(72) 発明者 田中 辰美  
 山口県宇部市大字小串1978番地の5 宇部  
 興産株式会社宇部研究所内